

51

BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

DEUTSCHES PATENTAMT



Int. Cl.:

C 07 c, 101/3

C 07 c, 93/12

A 61 k, 27/00

USAN 11/501,464
For IDS filed 11/10/06

52

Deutsche Kl.:

12 o, 25

30 h, 2/36

10

11

21

22

43

Offenlegungsschrift 2 259 260

Aktenzeichen: P 22 59 260.5

Anmeldetag: 4. Dezember 1972

Offenlegungstag: 6. Juni 1974

Ausstellungspriorität: —

30

Unionspriorität

32

Datum: —

33

Land: —

31

Aktenzeichen: —

54

Bezeichnung:

Neue Amine

61

Zusatz zu: —

62

Ausscheidung aus: —

71

Anmelder:

Merck Patent GmbH, 6100 Darmstadt

Vertreter gem. § 16 PatG: —

72

Als Erfinder benannt:

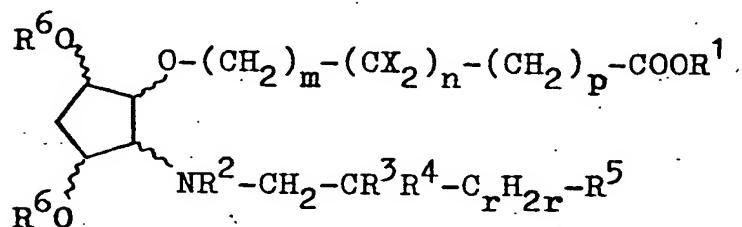
Orth, Dieter, Dipl.-Chem. Dr.; Cimbollek, Gerhard, Dr.;
Baumgarth, Manfred, Dr.; 6100 Darmstadt; Krämer, Josef, Dr.,
6101 Seeheim; Radunz, Hans, Dr., 6101 Traisa; Harting, Jürgen, Dr.,
6100 Darmstadt

BEST AVAILABLE COPY

2259260

N e u e A m i n e

Die Erfindung betrifft neue Verbindungen der allgemeinen Formel I



worin

- R^1 H, oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Cl, Br oder J substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Aralkyl oder Aryl mit jeweils bis zu 12 C-Atomen,
- R^2 und R^6 gleich oder ungleich sind, und H, Alkyl mit bis zu 4 C-Atomen, Benzyl oder Acyl mit bis zu 7 C-Atomen bedeuten,
- R^3 H, OH, Alkoxy mit bis zu 4 C-Atomen, Acyloxy mit bis zu 7 C-Atomen oder gemeinsam mit R^4 auch =O,
- R^4 H, Alkyl mit bis zu 5 C-Atomen oder gemeinsam mit R^3 auch =O,
- R^5 H, CF_3 , tert.-Butyl oder gegebenenfalls 1 - 3 mal durch Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 4 C-Atomen, F, Cl, CF_3 , NO_2 oder OH substituiertes Phenyl,
- X F, Cl oder Br,

m eine ganze Zahl zwischen 0 und 5,
 n 0, 1 oder 2,
 p eine ganze Zahl zwischen 1 oder 5
 und
 r eine ganze Zahl zwischen 0 und 7
 sind,

sowie deren physiologisch unbedenkliche Salze.

Es wurde gefunden, daß die Verbindungen der Formel I bei guter Verträglichkeit neben einer blutdrucksenkenden bzw. blutdrucksteigernden auch prostaglandinartige und antiprostaglandinartige Wirkungen besitzen. Die Verbindungen der Formel I können daher als Arzneimittel und auch als Zwischenprodukte zur Herstellung anderer Arzneimittel verwendet werden.

Gegenstand der Erfindung sind Verbindungen der Formel I, worin X, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, m, n, p und r die oben angegebene Bedeutung haben.

Ferner sind Gegenstand der Erfindung die Verbindungen der nachstehenden bevorzugten Formeln Ia bis Igi, die der Formel I entsprechen und worin die nicht näher bezeichneten Reste die bei Formel I angegebene Bedeutung haben, worin jedoch:

Ia R¹ = H

Ib R² = H

Ic R³ = H

Id R⁴ = H

Ie R⁵ = H

If R² = CH₃

Ig R³ = OH

Ih R⁴ = CH₃

Ii n = 0

Ij r = 5

Ik m = n = 0

Il m = n = 0, p = 1

| | |
|-----|---------------------------------|
| Im | $m = n = 0, p = 5$ |
| In | $m = n = 0, p = r = 5$ |
| Io | $R^1 = R^2 = H$ |
| Ip | $R^1 = H, R^2 = CH_3$ |
| Iq | $R^1 = R^3 = H$ |
| Ir | $R^1 = H, R^3 = OH$ |
| Is | $R^1 = R^4 = H$ |
| It | $R^1 = H, R^4 = CH_3$ |
| Iu | $R^1 = R^5 = H$ |
| Iv | $R^1 = H, n = 0$ |
| Iw | $R^2 = R^3 = H$ |
| Ix | $R^2 = H, R^3 = OH$ |
| Iy | $R^2 = R^4 = H$ |
| Iz | $R^2 = H, R^4 = CH_3$ |
| Iaa | $R^2 = R^5 = H$ |
| Iab | $R^2 = H, n = 0$ |
| Iac | $R^2 = CH_3, R^3 = H$ |
| Iad | $R^2 = CH_3, R^3 = OH$ |
| Iae | $R^2 = CH_3, R^4 = H$ |
| Iaf | $R^2 = R^4 = CH_3$ |
| Iag | $R^2 = CH_3, R^5 = H$ |
| Iah | $R^2 = CH_3, n = 0$ |
| Iai | $R^3 = R^4 = H$ |
| Iaj | $R^3 = H, R^4 = CH_3$ |
| Iak | $R^3 = R^5 = H$ |
| Ial | $R^3 = H, n = 0$ |
| Iam | $R^3 = OH, R^4 = H$ |
| Ian | $R^3 = OH, R^4 = CH_3$ |
| Iao | $R^3 = OH, R^5 = H$ |
| Iap | $R^3 = OH, n = 0$ |
| Iaq | $R^4 = R^5 = H$ |
| Iar | $R^4 = H, n = 0$ |
| Ias | $R^4 = CH_3, R^5 = H$ |
| Iat | $R^4 = CH_3, n = 0$ |
| Iau | $R^1 = R^2 = H, R^3 = OH$ |
| Iav | $R^1 = R^3 = H, R^2 = CH_3$ |
| Iaw | $R^1 = H, R^2 = CH_3, R^3 = OH$ |
| Iax | $R^1 = R^2 = R^4 = H$ |
| Iay | $R^1 = R^2 = H, R^4 = CH_3$ |

| | |
|-----|---|
| Iaz | $R^1 = R^4 = H, R^2 = CH_3$ |
| Iba | $R^1 = H, R^2 = R^4 = CH_3$ |
| Ibb | $R^1 = R^2 = R^5 = H$ |
| Ibc | $R^1 = R^5 = H, R^2 = CH_3$ |
| Ibd | $R^1 = R^3 = R^4 = H$ |
| Ibe | $R^1 = R^3 = H, R^4 = CH_3$ |
| Ibf | $R^1 = R^4 = H, R^3 = OH$ |
| Ibg | $R^1 = H, R^3 = OH, R^4 = CH_3$ |
| Ibh | $R^1 = R^3 = R^5 = H$ |
| Ibi | $R^1 = R^5 = H, R^3 = OH$ |
| Ibj | $R^1 = R^4 = R^5 = H$ |
| Ibk | $R^1 = R^5 = H, R^4 = CH_3$ |
| Ibl | $R^2 = R^3 = R^4 = H$ |
| Ibm | $R^1 = R^2 = R^3 = R^4 = R^5 = H, m = n = 0$ |
| Ibn | $R^1 = R^2 = R^3 = R^4 = R^5 = H, m = n = 0, r = 1$ |
| Ibo | $R^1 = R^2 = R^3 = R^4 = R^5 = H, m = n = 0, r = 5$ |
| Ibp | $R^1 = R^2 = R^3 = R^4 = H, R^5 = \text{Phenyl}, m = n = 0, r = 1$ |
| Ibq | $R^1 = R^2 = R^3 = R^4 = H, R^5 = \text{Phenyl}, m = n = 0, r = 5$ |
| Ibr | $R^1 = R^2 = R^3 = R^4 = H, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Ibs | $R^1 = R^2 = R^3 = R^4 = H, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 4$ |
| Ibt | $R^1 = R^2 = R^3 = R^4 = H, R^5 = \text{tert.-Butyl}, m = n = 0, r = 1$ |
| Ibu | $R^1 = R^2 = R^3 = R^4 = H, R^5 = \text{tert.-Butyl}, m = n = 0, r = 3$ |
| Ibv | $R^1 = R^2 = R^3 = R^5 = H, R^4 = CH_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Ibw | $R^1 = R^2 = R^3 = R^5 = H, R^4 = CH_3, m = n = 0, r = 5$ |
| Ibx | $R^1 = R^2 = R^3 = H, R^4 = CH_3, R^5 = \text{Phenyl}, m = n = 0, r = 1$ |
| Iby | $R^1 = R^2 = R^3 = H, R^4 = CH_3, R^5 = \text{Phenyl}, m = n = 0, r = 5$ |
| Ibz | $R^1 = R^2 = R^3 = H, R^4 = CH_3, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Ica | $R^1 = R^2 = R^3 = H, R^4 = CH_3, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 4$ |
| Icb | $R^1 = R^2 = R^3 = H, R^4 = CH_3, R^5 = \text{tert.-Butyl}, m = n = 0, r = 1$ |
| Icc | $R^1 = R^2 = R^3 = H, R^4 = CH_3, R^5 = \text{tert.-Butyl}, m = n = 0, r = 3$ |
| Icd | $R^1 = R^2 = R^3 = R^5 = H, R^4 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $m = n = 0, r = 1$ |
| Ice | $R^1 = R^2 = R^3 = R^5 = H, R^4 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $m = n = 0, r = 5$ |
| Icf | $R^1 = R^2 = R^4 = R^5 = H, R^3 = OH, m = n = 0, r = 1$ |
| Icg | $R^1 = R^2 = R^4 = R^5 = H, R^3 = OH, m = n = 0, r = 5$ |
| Ich | $R^1 = R^2 = R^4 = H, R^3 = OH, R^5 = \text{Phenyl}, m = n = 0, r = 1$ |
| Ici | $R^1 = R^2 = R^4 = H, R^3 = OH, R^5 = \text{Phenyl}, m = n = 0, r = 5$ |
| Icj | $R^1 = R^2 = R^4 = H, R^3 = OH, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 1$ |

| | |
|-----|--|
| Ick | $R^1 = R^2 = R^4 = H, R^3 = OH, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 4$ |
| Icl | $R^1 = R^2 = R^4 = H, R^3 = OH, R^5 = \text{tert.-Butyl},$ $m = n = 0, r = 1$ |
| Icm | $R^1 = R^2 = R^4 = H, R^3 = OH, R^5 = \text{tert.-Butyl},$ $m = n = 0, r = 3$ |
| Icn | $R^1 = R^2 = R^5 = H, R^3 = OH, R^4 = CH_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Ico | $R^1 = R^2 = R^5 = H, R^3 = OH, R^4 = CH_3, m = n = 0, r = 5$ |
| Icp | $R^1 = R^2 = H, R^3 = OH, R^4 = CH_3, R^5 = \text{Phenyl},$ $m = n = 0, r = 1$ |
| Icq | $R^1 = R^2 = H, R^3 = OH, R^4 = CH_3, R^5 = \text{Phenyl},$ $m = n = 0, r = 5$ |
| Icr | $R^1 = R^2 = H, R^3 = OH, R^4 = CH_3, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Ics | $R^1 = R^2 = H, R^3 = OH, R^4 = CH_3, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 4$ |
| Ict | $R^1 = R^2 = H, R^3 = OH, R^4 = CH_3, R^5 = \text{tert.-Butyl},$ $m = n = 0, r = 1$ |
| Icu | $R^1 = R^2 = H, R^3 = OH, R^4 = CH_3, R^5 = \text{tert.-Butyl},$ $m = n = 0, r = 3$ |
| Icv | $R^1 = R^2 = R^5 = H, R^3 = OH, R^4 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $m = n = 0, r = 1$ |
| Icw | $R^1 = R^2 = R^5 = H, R^3 = OH, R^4 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $m = n = 0, r = 5$ |
| Icx | $R^1 = R^2 = R^4 = R^5 = H, R^3 = OCH_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Icy | $R^1 = R^2 = R^4 = R^5 = H, R^3 = OCH_3, m = n = 0, r = 5$ |
| Icz | $R^1 = R^2 = R^5 = H, R^3 = OCH_3, R^4 = CH_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Ida | $R^1 = R^2 = R^5 = H, R^3 = OCH_3, R^4 = CH_3, m = n = 0, r = 5$ |
| Idb | $R^1 = R^2 = R^5 = H, R^3 = OCH_3, R^4 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $m = n = 0, r = 1$ |
| Idc | $R^1 = R^2 = R^5 = H, R^3 = OCH_3, R^4 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $m = n = 0, r = 5$ |
| Idd | $R^1 = R^4 = R^5 = H, R^2 = \text{Acetyl}, R^3 = \text{Acetoxy}, m = n = 0, r = 1$ |
| Ide | $R^1 = R^4 = R^5 = H, R^2 = \text{Acetyl}, R^3 = \text{Acetoxy}, m = n = 0, r = 5$ |
| Idf | $R^1 = R^5 = H, R^2 = \text{Acetyl}, R^3 = \text{Acetoxy}, R^4 = CH_3,$ $m = n = 0, r = 1$ |
| Idg | $R^1 = R^5 = H, R^2 = \text{Acetyl}, R^3 = \text{Acetoxy}, R^4 = CH_3,$ $m = n = 0, r = 5$ |
| Idh | $R^1 = R^5 = H, R^2 = \text{Acetyl}, R^3 = \text{Acetoxy}, R^4 = \text{Alkyl mit}$ $2 - 4 \text{ C-Atomen}, m = n = 0, r = 1$ |
| Idi | $R^1 = R^5 = H, R^2 = \text{Acetyl}, R^3 = \text{Acetoxy}, R^4 = \text{Alkyl mit}$ $2 - 4 \text{ C-Atomen}, m = n = 0, r = 5$ |
| Idj | $R^1 = R^3 = R^4 = R^5 = H, R^2 = CH_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Idk | $R^1 = R^3 = R^4 = R^5 = H, R^2 = CH_3, m = n = 0, r = 5$ |
| Idl | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = CH_3, R^5 = \text{Phenyl}, m = n = 0, r = 1$ |

| | |
|-----|---|
| Idm | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = CH_3, R^5 = Phenyl, m = n = 0, r = 5$ |
| Idn | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = CH_3, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Ido | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = CH_3, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 4$ |
| Idp | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = CH_3, R^5 = tert. Butyl, m = n = 0, r = 1$ |
| Idq | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = CH_3, R^5 = tert.-Butyl, m = n = 0, r = 3$ |
| Idr | $R^1 = R^4 = R^5 = H, R^2 = CH_3, R^3 = OH, m = n = 0, r = 1$ |
| Ids | $R^1 = R^4 = R^5 = H, R^2 = CH_3, R^3 = CH, m = n = 0, r = 5$ |
| Idt | $R^1 = R^4 = H, R^2 = CH_3, R^3 = OH, R^5 = Phenyl, m = n = 0, r = 1$ |
| Idu | $R^1 = R^4 = H, R^2 = CH_3, R^3 = OH, R^5 = Phenyl, m = n = 0, r = 5$ |
| Idv | $R^1 = R^4 = H, R^2 = CH_3, R^3 = OH, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Idw | $R^1 = R^4 = H, R^2 = CH_3, R^3 = OH, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 4$ |
| Idx | $R^1 = R^4 = H, R^2 = CH_3, R^3 = OH, R^5 = tert.-Butyl, m = n = 0, r = 1$ |
| Idy | $R^1 = R^4 = H, R^2 = CH_3, R^3 = OH, R^5 = tert.-Butyl, m = n = 0, r = 3$ |
| Idz | $R^1 = R^3 = R^5 = H, R^2 = R^4 = CH_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Iea | $R^1 = R^3 = R^5 = H, R^2 = R^4 = CH_3, m = n = 0, r = 5$ |
| Ieb | $R^1 = R^3 = H, R^2 = R^4 = CH_3, R^5 = Phenyl, m = n = 0, r = 1$ |
| Iec | $R^1 = R^3 = H, R^2 = R^4 = CH_3, R^5 = Phenyl, m = n = 0, r = 5$ |
| Ied | $R^1 = R^3 = H, R^2 = R^4 = CH_3, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Iee | $R^1 = R^3 = H, R^2 = R^4 = CH_3, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 4$ |
| Ief | $R^1 = R^3 = H, R^2 = R^4 = CH_3, R^5 = tert.-Butyl, m = n = 0, r = 1$ |
| Ieg | $R^1 = R^3 = H, R^2 = R^4 = CH_3, R^5 = tert.-Butyl, m = n = 0, r = 3$ |
| Ieh | $R^1 = R^5 = H, R^2 = R^4 = CH_3, R^3 = OH, m = n = 0, r = 1$ |
| Iei | $R^1 = R^5 = H, R^2 = R^4 = CH_3, R^3 = OH, m = n = 0, r = 5$ |
| Iej | $R^1 = R^5 = H, R^2 = CH_3, R^3 = OH, R^4 = Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen, m = n = 0, r = 1$ |
| Iek | $R^1 = R^5 = H, R^2 = CH_3, R^3 = OH, R^4 = Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen, m = n = 0, r = 5$ |
| Iel | $R^1 = R^4 = R^5 = H, R^2 = CH_3, R^3 = OCH_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Iem | $R^1 = R^4 = R^5 = H, R^2 = CH_3, R^3 = OCH_3, m = n = 0, r = 5$ |
| Ien | $R^1 = R^4 = R^5 = H, R^2 = CH_3, R^3 = Acetoxy, m = n = 0, r = 1$ |
| Ieo | $R^1 = R^4 = R^5 = H, R^2 = CH_3, R^3 = Acetoxy, m = n = 0, r = 5$ |
| Iep | $R^1 = R^5 = H, R^2 = R^4 = CH_3, R^3 = OCH_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Ieq | $R^1 = R^5 = H, R^2 = R^4 = CH_3, R^3 = OCH_3, m = n = 0, r = 5$ |

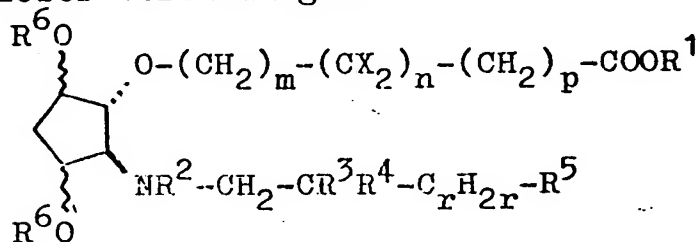
| | |
|-----|---|
| Ier | $R^1 = R^5 = H, R^2 = R^4 = CH_3, R^3 = \text{Acetoxy}, m = n = 0, r = 1$ |
| Ies | $R^1 = R^5 = H, R^2 = R^4 = CH_3, R^3 = \text{Acetoxy}, m = n = 0, r = 5$ |
| Iet | $R^1 = R^3 = R^4 = R^5 = H, R^2 = \text{Acetyl}, m = n = 0, r = 1$ |
| Ieu | $R^1 = R^3 = R^4 = R^5 = H, R^2 = \text{Acetyl}, m = n = 0, r = 5$ |
| Iev | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = \text{Acetyl}, R^5 = \text{Phenyl}, m = n = 0, r = 1$ |
| Iew | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = \text{Acetyl}, R^5 = \text{Phenyl}, m = n = 0, r = 5$ |
| Iex | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = \text{Acetyl}, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Iey | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = \text{Acetyl}, R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 4$ |
| Iez | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = \text{Acetyl}, R^5 = \text{tert.-Butyl},$ $m = n = 0, r = 1$ |
| Ifa | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = \text{Acetyl}, R^5 = \text{tert.-Butyl},$ $m = n = 0, r = 3$ |
| Ifb | $R^1 = R^3 = R^5 = H, R^2 = \text{Acetyl}, R^4 = CH_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Ifc | $R^1 = R^3 = R^5 = H, R^2 = \text{Acetyl}, R^4 = CH_3, m = n = 0, r = 5$ |
| Ifd | $R^1 = R^3 = R^4 = R^5 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $m = n = 0, r = 1$ |
| Ife | $R^1 = R^3 = R^4 = R^5 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $m = n = 0, r = 5$ |
| Iff | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $R^5 = \text{Phenyl}, m = n = 0, r = 1$ |
| Ifg | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $R^5 = \text{Phenyl}, m = n = 0, r = 5$ |
| Ifh | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Ifi | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 4$ |
| Ifj | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $R^5 = \text{tert.-Butyl}, m = n = 0, r = 1$ |
| Ifk | $R^1 = R^3 = R^4 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $R^5 = \text{tert.-Butyl}, m = n = 0, r = 3$ |
| Ifl | $R^1 = R^4 = R^5 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $R^3 = OH, m = n = 0, r = 1$ |
| Ifm | $R^1 = R^4 = R^5 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen},$ $R^3 = OH, m = n = 0, r = 5$ |
| Ifn | $R^1 = R^4 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}, R^3 = OH,$ $R^5 = \text{Phenyl}, m = n = 0, r = 1$ |
| Ifo | $R^1 = R^4 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}, R^3 = OH,$ $R^5 = \text{Phenyl}, m = n = 0, r = 5$ |
| Ifp | $R^1 = R^4 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}, R^3 = OH,$ $R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 1$ |
| Ifq | $R^1 = R^4 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}, R^3 = OH,$ $R^5 = CF_3, m = n = 0, r = 4$ |
| Ifr | $R^1 = R^4 = H, R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}, R^3 = OH,$ $R^5 = \text{tert.-Butyl}, m = n = 0, r = 1$ |

- 1
5
- Ifs $R^1 = R^4 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$, $R^3 = OH$,
 $R^5 = \text{tert.-Butyl}$, $m = n = 0$, $r = 3$
- Ift $R^1 = R^4 = R^5 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$, $R^3 = OCH_3$,
 $m = n = 0$, $r = 1$
- Ifu $R^1 = R^4 = R^5 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$, $R^3 = OCH_3$,
 $m = n = 0$, $r = 5$
- Ifv $R^1 = R^4 = R^5 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$,
 $R^3 = \text{Acetoxy}$, $m = n = 0$, $r = 1$
- Ifw $R^1 = R^4 = R^5 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$,
 $R^3 = \text{Acetoxy}$, $m = n = 0$, $r = 5$
- Ifx $R^1 = R^5 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$, $R^3 = OH$,
 $R^4 = CH_3$, $m = n = 0$, $r = 1$
- Ify $R^1 = R^5 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$, $R^3 = OH$,
 $R^4 = CH_3$, $m = n = 0$, $r = 5$
- Ifz $R^1 = R^5 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$, $R^3 = OCH_3$,
 $R^4 = CH_3$, $m = n = 0$, $r = 1$
- Iga $R^1 = R^5 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$, $R^3 = OCH_3$,
 $R^4 = CH_3$, $m = n = 0$, $r = 5$
- Igb $R^1 = R^5 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$, $R^3 = \text{Acetoxy}$,
 $R^4 = CH_3$, $m = n = 0$, $r = 1$
- Igc $R^1 = R^5 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$, $R^3 = \text{Acetoxy}$,
 $R^4 = CH_3$, $m = n = 0$, $r = 5$
- Igd $R^1 = R^4 = R^5 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$,
 $R^3 = \text{Alkoxy mit 2 - 4 C-Atomen}$, $m = n = 0$, $r = 1$
- Ige $R^1 = R^4 = R^5 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$,
 $R^3 = \text{Alkoxy mit 2 - 4 C-Atomen}$, $m = n = 0$, $r = 5$
- Igf $R^1 = R^5 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$, $R^3 = \text{Alkoxy}$
mit 2 - 4 C-Atomen, $R^4 = CH_3$, $m = n = 0$, $r = 1$
- Igg $R^1 = R^5 = H$, $R^2 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$, $R^3 = \text{Alkoxy}$
mit 2 - 4 C-Atomen, $R^4 = CH_3$, $m = n = 0$, $r = 5$
- Igh $R^1 = R^5 = H$, $R^2 = R^4 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$,
 $R^3 = \text{Alkoxy mit 2 - 4 C-Atomen}$, $m = n = 0$, $r = 1$
- Igi $R^1 = R^5 = H$, $R^2 = R^4 = \text{Alkyl mit 2 - 4 C-Atomen}$,
 $R^3 = \text{Alkoxy mit 2 - 4 C-Atomen}$, $m = n = 0$, $r = 5$.

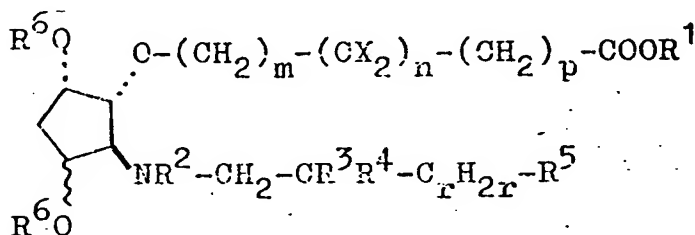
Die Verbindungen der Formel I und damit auch die Verbindungen der Formeln Ia - Igi enthalten vier asymmetrische C-Atome im Fünfring. In den beiden Seitenketten können weitere Asymmetriezentren auftreten.

Die Verbindungen der Formel I und damit auch die Verbindungen der Formeln Ia - Igi können daher in einer Vielzahl stereoisomerer Formen auftreten und liegen in der Regel als Gemische von Racematen vor.

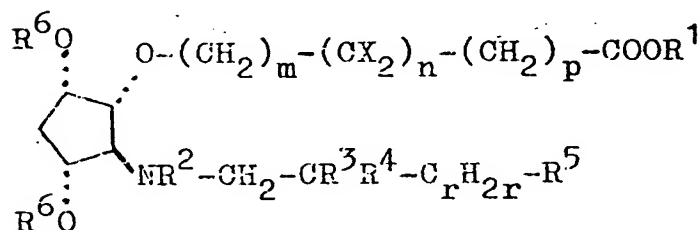
Gegenstand der Erfindung sind auch optisch aktive Verbindungen der Formel I, vorzugsweise der Formeln Ia bis Igi sowie deren Racemate. Besonders bevorzugt sind die optisch aktiven Stereoisomeren der Formeln Igj - Igr, ihre optischen Antipoden und ihre Racemate, sowie die physiologisch unbedenklichen Salze dieser Verbindungen:



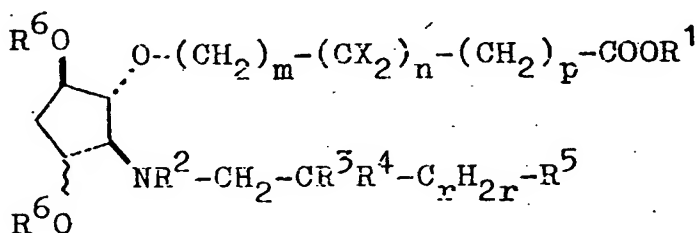
Igj



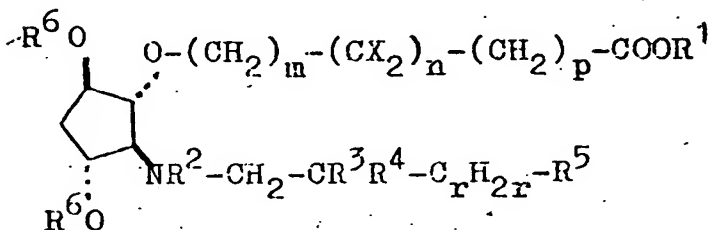
Igk



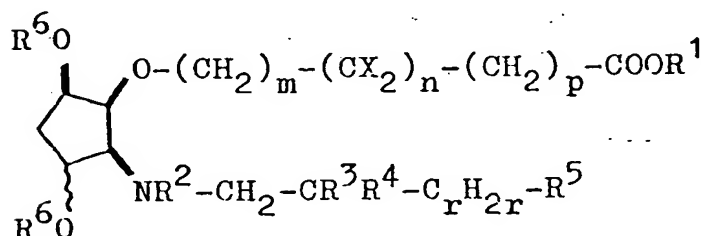
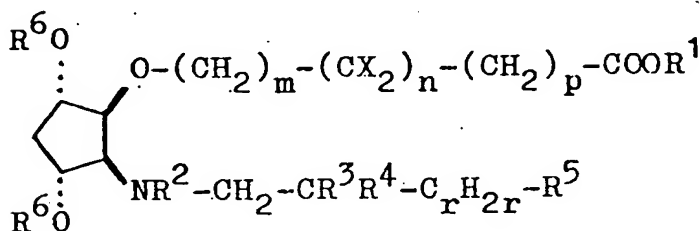
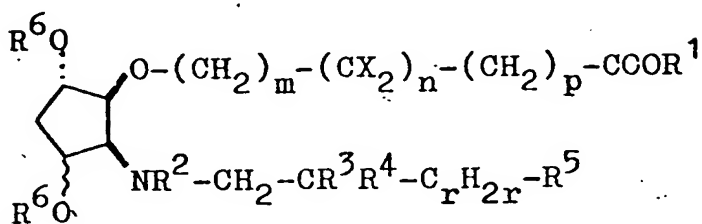
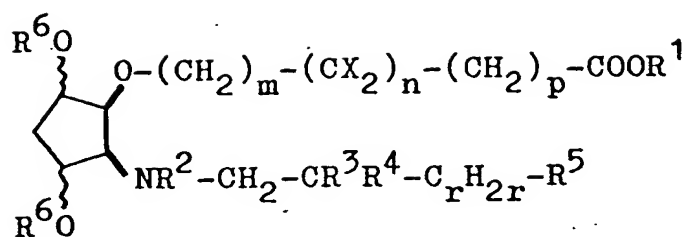
Igl



Igm



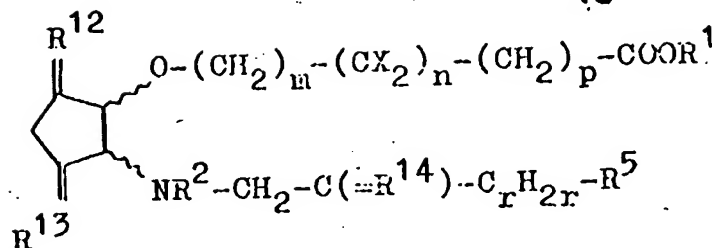
Ign



Insbesondere sind solche Verbindungen bevorzugt, welche die in den Formeln Igj bis Igr dargestellten sterischen Verhältnisse aufweisen und bei denen R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , m , n und r die bei den Formeln Ia bis Igi angegebene Bedeutung haben.

- 12 -

43



IV

worin

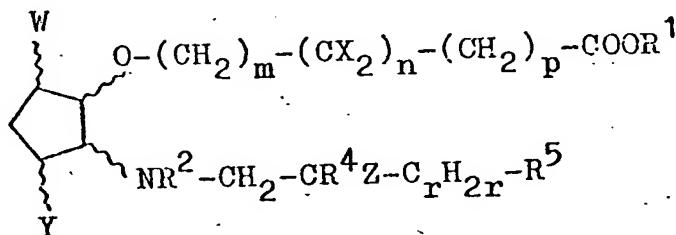
R^{12} und R^{13} gleich oder ungleich sind und
 $=O$ oder (H, OR^6) bedeuten und

$R^{14} = O$ oder (R^3, R^4) bedeutet und
 wenigstens ein Rest R^{12} , R^{13} oder
 $R^{14} = O$ ist, und

R^1 bis R^5 und X , m , n , p und r die oben
 angegebene Bedeutung haben,

mit einem reduzierenden Mittel umgesetzt,

oder eine Verbindung der allgemeinen Formel V,



V

worin

W und Y gleich oder ungleich sind und OR^6 ,
 Hal, Alkylsulfonyloxy mit bis zu
 4 C-Atomen oder Arylsulfonyloxy
 mit bis zu 10 C-Atomen bedeuten,
 und

Z R^3 oder Hal, Alkylsulfonyloxy mit bis
 zu 4 C-Atomen oder Arylsulfonyloxy
 mit bis zu 10 C-Atomen bedeutet und
 mindestens einer der Reste X , Y und
 Z Hal, Alkylsulfonyloxy mit bis zu
 4 C-Atomen oder Arylsulfonyloxy mit
 bis zu 10 C-Atomen ist, und

- 13 -

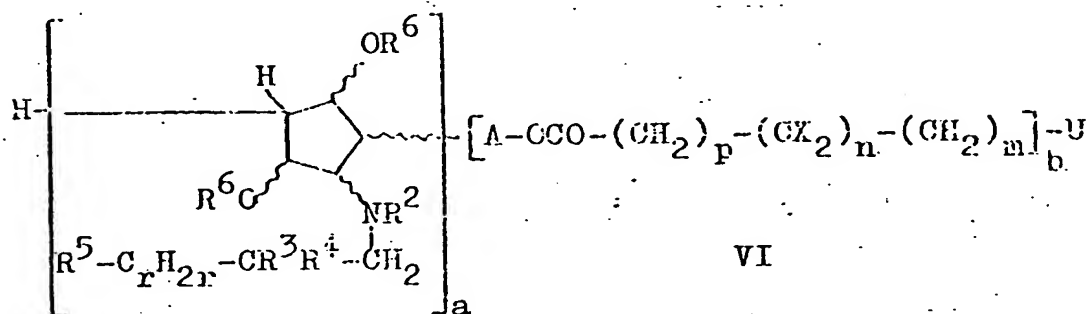
Hal. Cl, Br oder J bedeutet, und

wenigstens ein Rest Y oder W ungleich OR^6 ist,
wenn Z gleich R^3 ist, und

R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , X, m, n, p und r die oben
angegebene Bedeutung haben,

mit solvolysierenden Mitteln behandelt,

oder eine Verbindung der allgemeinen Formel VI,



worin

A gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch
Cl, Br oder J substituiertes Alkylen, Cy-
cloalkylen, Aralkylen oder Arylen mit
jeweils bis zu 12 C-Atomen oder einen
Valenzstrich,

U Hal, Alkylsulfonyloxy mit bis zu 4 C-Atomen
oder Arylsulfonyloxy mit bis zu 10 C-Atomen

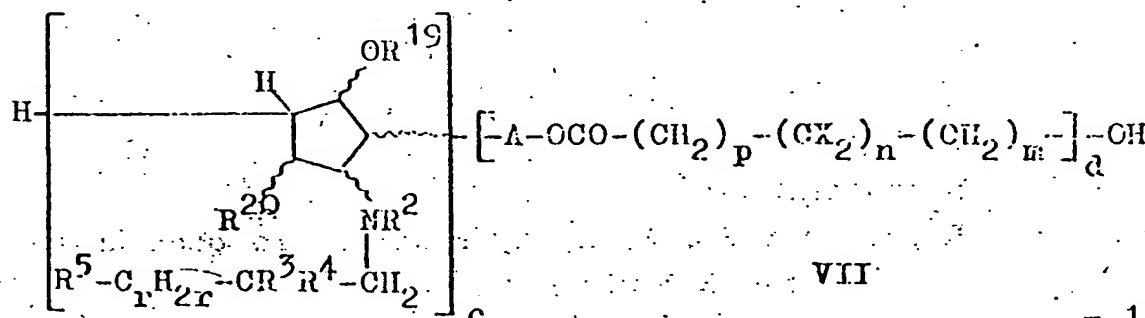
a 0 oder 1 und

b 1 oder 0

bedeuten, und

R^2 bis R^6 , X, m, n, p und r die oben angegebene
Bedeutung haben,

mit einer Verbindung der allgemeinen Formel VII,



worin

R^{19} und R^{20} gleich oder ungleich sind, und
Alkyl mit bis zu 4 C-Atomen, Benzyl oder
Acyl mit bis zu 7 C-Atomen bedeuten

c 0 oder 1 und

d 1 oder 0

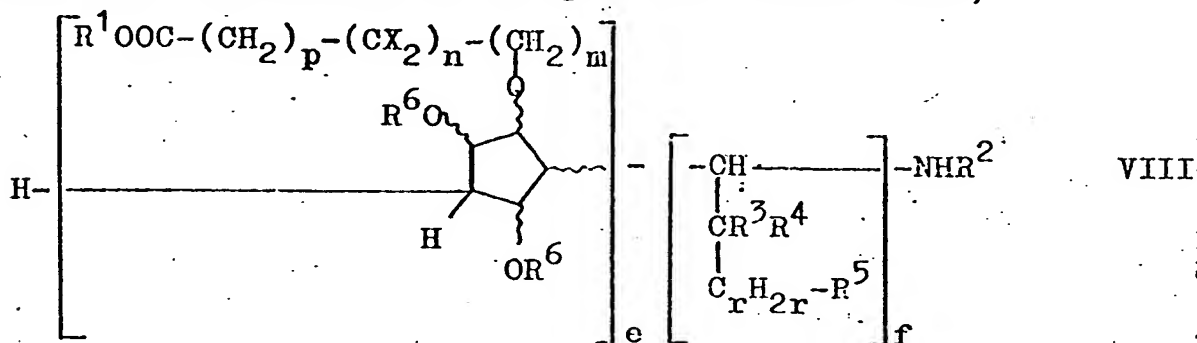
bedeuten, und

R^2 bis R^5 , X, m, n, p und r die oben angegebene
Bedeutung haben, und

$(a + b) = (c + d) = (a + c) = 1$ ist,

umsetzt,

oder eine Verbindung der allgemeinen Formel VIII,



worin

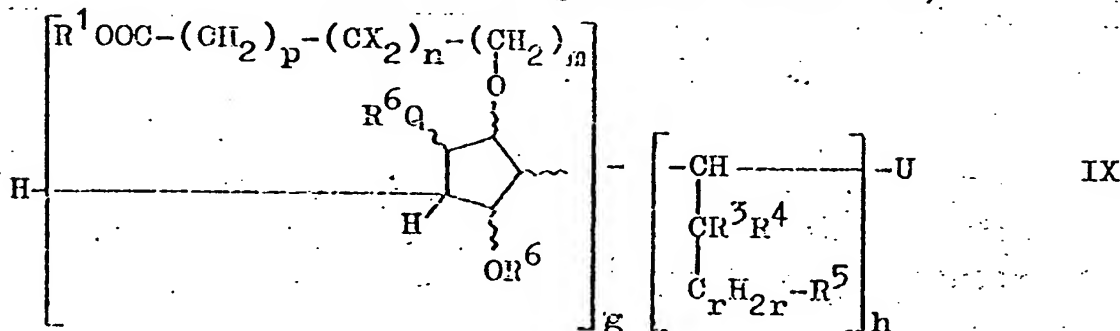
e 0 oder 1 und

f 1 oder 0

bedeuten, und

R^1 bis R^6 , X, m, n, p und r die oben angegebene
Bedeutung haben,

mit einer Verbindung der allgemeinen Formel IX,



worin

g 0 oder 1 und

h 1 oder 0

bedeuten, und

R^1 , R^3 bis R^5 , X, m, n, p und r die oben ange-
gebene Bedeutung haben,

$(e + f) = (g + f) = (e + g) = 1$ ist,
umsetzt,

und/oder eine erhaltene Verbindung der Formel I durch Behandeln mit veresternden, acylierenden, alkylierenden, hydrogenolysierenden, thermolysierenden oder solvolysierenden Mitteln in eine andere Verbindung der Formel I überführt,

und/oder eine Verbindung, die sonst der Formel I entspricht, in welcher aber noch unerwünschte C-C- oder C-N-Mehrfachverbindungen vorhanden sind, durch Behandeln mit einem reduzierenden Mittel in eine Verbindung der Formel I überführt,

und/oder daß man eine Verbindung der Formel I in ihre Racemate und/oder optischen Antipoden spaltet,

und/oder eine Verbindung der Formel I durch Behandeln mit einer Säure oder Base in ihre physiologisch unbedenklichen Salze überführt oder durch Behandeln mit einer Base oder Säure aus ihren Salzen in Freiheit setzt.

In den vorstehenden Formeln bedeutet R^1 vorzugsweise neben Wasserstoff einen Alkylrest mit bis zu 12 C-Atomen, welcher auch ein- oder mehrfach durch Cl, Br oder J substituiert sein kann. Vor allem handelt es sich um unsubstituiertes Alkyl mit insbesondere bis zu 6 C-Atomen, z.B. um Methyl-, Äthyl-, n-Propyl-, n-Butyl-, n-Pentyl-, n-Hexyl-, Isopropyl-, Isobutyl-, sek.-Butyl-, tert.-Butyl-, Isopentyl-, Pent-2-yl-, Pent-3-yl-, tert.-Pentyl-, Neopentyl-, Hex-2-yl-, Hex-3-yl-, oder Isohexylgruppen, aber beispielsweise auch um n-Heptyl-, n-Octyl-, n-Nonyl-, n-Decyl-, n-Undecyl- oder n-Dodecylreste, sowie um Haloalkylreste wie 2-Chloräthyl-, 2-Bromäthyl-, 2-Jodäthyl-, 2,2-Dibromäthyl-, 2,2-Dijodäthyl-, 2,2,2-Trichloräthyl-, 2,2,2-Tribromäthyl- oder 2,2,2-Trijodäthylgruppen.

Beispiele für Cycloalkylgruppen mit bis zu 12 C-Atomen einschließlich, zu denen auch alkylsubstituierte Cycloalkylreste gehören, sind Cyclopropyl-, 2-Methylcyclopropyl-, 2,2-Dimethylcyclopropyl-, 2,3-Diäthylcyclopropyl-, 2-Butylcyclopropyl-,

Cyclobutyl-, 2-Methylcyclobutyl-, 3-Propylcyclobutyl-, 2,3,4-Triäthylcyclobutyl-, Cyclopentyl-, 2,2-Dimethylcyclopentyl-, 3-Pentylcyclopentyl-, 3-tert.-Butylcyclopentyl-, Cyclohexyl-, 4-tert.-Butylcyclohexyl-, 3-Isopropylcyclohexyl-, 2,2-Dimethylcyclohexyl-, Cycloheptyl-, Cyclooctyl-, Cyclononyl-, Cyclodecyl-, Cycloundecyl- und Cyclododecylgruppen.

Beispiele für Aralkylgruppen mit bis zu 12 C-Atomen einschließlich sind Benzyl-, Phenäthyl-, 1-Phenyläthyl-, 2-Phenylpropyl-, 4-Phenylbutyl-, 3-Phenylbutyl-, 2-(1-Naphthyläthyl)- und 1-(2-Naphthylmethyl)-Gruppen.

Handelt es sich bei R^1 um Aryl mit bis zu 12 C-Atomen, so sind unsubstituierte Kohlenwasserstoffreste wie Phenyl, 1-Naphthyl oder 2-Naphthyl bevorzugt, es kann aber auch ein vorzugsweise durch Halogen und/oder Alkyl mit bis zu 4 C-Atomen substituierter Arylrest sein, beispielsweise p-Chlorphenyl-, m-Chlorphenyl-, o-Chlorphenyl-, 2,4-Dichlorphenyl-, 2,4,6-Trichlorphenyl-, p-Tolyl-, m-Tolyl-, o-Tolyl-, p-Äthylphenyl-, p-tert.-Butylphenyl-, 2,5-Dimethylphenyl-, 4-Chlor-2-methylphenyl- und 2,4-Dichlor-3-methylphenylgruppen.

R^2 und R^6 sind gleich oder ungleich und bedeuten neben H Alkyl mit bis zu 4 C-Atomen, vorzugsweise Methyl, Äthyl, Propyl, tert.-Butyl; oder Acyl mit bis zu 7 C-Atomen, wobei sich der Acylrest vorzugsweise von einer gesättigten oder ungesättigten aliphatischen, cycloaliphatischen oder aromatischen, substituierten oder unsubstituierten Carbonsäure oder Sulfonsäure oder auch einer anorganischen Säure ableitet. Bevorzugte Carbonsäuren sind gesättigte Fettsäuren mit 1 - 7, vorzugsweise 1 - 4 C-Atomen, wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure, Buttersäure oder Isobuttersäure; aber auch Valeriansäure, Isovaleriansäure, Pivalinsäure, Capronsäure, Isocapronsäure, Önanthensäure, Diäthylessigsäure; ferner ungesättigte Fettsäuren, wie Acrylsäure, Crotonsäure, Acetylen-carbonsäure; alicyclische Carbonsäuren, wie Cyclopropancarbonsäure oder Cyclohexancarbonsäure; aromatische Carbonsäuren,

wie Benzoesäure; Dicarbonsäuren, wie Oxal-, Malon-, Bernstein-, Malein-, Glutar-, Dimethylglutar-, Adipin-, Pimelin- oder Acetondicarbonsäure; Hydroxycarbonsäuren, wie Glykolsäure; Halogenfettsäuren, wie Chloressigsäure, Dichloressigsäure, Trichloressigsäure oder Trifluoressigsäure; aber z.B. auch o-, m- oder p-Chlorbenzoesäure; oder heterocyclische Carbonsäuren, wie Nicotinsäure oder Furancarbonsäure. R^6 ist insbesondere auch ein Benzylrest.

Bevorzugte Sulfonsäuren sind Alkylsulfonsäuren mit 1 - 6 C-Atomen, z.B. Methan-, Aethan- oder 2-Hydroxyäthansulfonsäure; oder Arylsulfonsäuren, z.B. Benzol-, p-Toluol- oder p-Bromphenylsulfonsäure. Bevorzugte anorganische Säuren sind Schwefelsäure und Phosphorsäure.

R^3 ist neben H und OH auch Alkoxy mit bis zu 4 C-Atomen, beispielsweise Methoxy, Äthoxy, Propyloxy, Isopropyloxy oder tert.-Butyloxy; oder Acyloxy mit bis zu 7 C-Atomen, wobei sich der Acylrest vorzugsweise von einer der bei R^2 angegebenen Säuren ableitet.

R^4 ist neben H auch Alkyl mit bis zu 5 C-Atomen, vorzugsweise unverzweigtes Alkyl wie Methyl, Äthyl, Propyl oder Butyl; aber auch Isopropyl, Isobutyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl oder Pentyl.

R^3 und R^4 können gemeinsam auch = 0 sein.

R^5 bedeutet neben H, CF_3 , tert.-Butyl einen gegebenenfalls 1 - 3 mal durch Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 4 C-Atomen, Cl, CF_3 , NO_2 oder OH substituierten Phenylrest, vorzugsweise einen o-, m-, p-Tolyl, 2-Methoxy-, 3-Methoxy-, 4-Methoxy-, 2-Fluor-, 3-Fluor-, 4-Fluor-, 2-Chlor-, 3-Chlor-, 4-Chlor-, 2-Brom-, 3-Brom-, 4-Brom-, 4-Jod-, 3-Trifluormethyl-, 4-Trifluormethyl-, 2-Nitro-, 3-Nitro-, 4-Nitro-, 2-Hydroxy-, 3-Hydroxy-, 4-Hydroxy-, 3,4-Dimethyl-, 3,5-Dimethyl-, 2,5-Dimethyl-, 2,4-Dimethyl, 2,5-Dimethyl-, 2,4-Diäthyl-, 3,4-Diäthyl-, 2-Methyl-3-äthyl-, 2-Methyl-4-äthyl-, 2-Methyl-3-butyl-, 2-Methyl-4-butyl-, 2-Äthyl-4-butyl, 4-tert.-Butyl-, 2-Butyl-4-isopropyl-, 3,5-Dimethoxy-, 2-Fluor-5-methoxy-,

2-Chlor-5-methoxy-, 2-Brom-5-methoxy-, 5-Methoxy-2-methyl-, 3-Methoxy-4-methyl-, 4-Brom-2,5-dimethoxy-, 2-Chlor-5-methoxy-4-methyl-, 3,4,5-Trimethoxy-, 2,3,5-Trimethoxy-, 3,5-Diäthoxy-, 3,5-Di-n-propoxy-, 3,5-Di-n-butoxy-, 2-Fluor-5-äthoxy-, 2-Chlor-5-äthoxy-, 2-Brom-5-äthoxy-, 5-Methoxy-2-äthyl-, 5-Methoxy-2-n-propyl-, 5-Methoxy-2-isopropyl-, 5-Methoxy-2-n-butyl-, 5-Methoxy-2-isobutyl-, 5-Methoxy-2-sek.-butyl-, 5-Methoxy-2-tert.-butyl-, 5-Methoxy-2-trifluormethyl-, 3-Fluor-2,5-dimethoxy-, 3-Chlor-2,5-dimethoxy-, 3-Brom-2,5-dimethoxy-, 3-Methyl-2,5-dimethoxy-, 3-Äthyl-2,5-dimethoxy-, 3-n-Propyl-2,5-dimethoxy-, 3-Trifluormethyl-2,5-dimethoxy-, 4-Fluor-2,5-dimethoxy-, 4-Chlor-2,5-dimethoxy-, 4-Methyl-2,5-dimethoxy-, 4-Äthyl-2,5-dimethoxy-, 4-n-Propyl-2,5-dimethoxy-, 2-Fluor-3,5-dimethoxy-, 2-Chlor-3,5-dimethoxy-, 2-Brom-3,5-dimethoxy-, 2-Methyl-3,5-dimethoxy-, 2-Äthyl-3,5-dimethoxy-, 2-n-Propyl-3,5-dimethoxy-, 2-Trifluormethyl-3,5-dimethoxy-phenylrest.

Der Buchstabe m bedeutet 0, 1, 2, 3, 4 oder 5; auch p bedeutet 0, 1, 2, 3, 4 oder 5; n bedeutet 0, 1 oder 2.

Die Summe von m + n + p ist vorzugsweise 4, 5, 6 oder 7, insbesondere aber 5 oder 6, wobei n bevorzugt 0 ist.

Der Buchstabe r ist 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6 oder 7, vorzugsweise aber 4, 5, 6 oder 7, und insbesondere 5, vor allem wenn $R^5 = H$ ist.

R^8 und R^9 sind gleich oder verschieden und bedeuten eine mit hydrogenolysierenden oder hydrolysierenden Mitteln abspaltbare Gruppe.

Es handelt sich vorzugsweise um Acylreste mit bis zu 20 C-Atomen, die z.B. von einer gesättigten oder ungesättigten aliphatischen, cycloaliphatischen oder aromatischen, substituierten oder unsubstituierten Carbonsäure oder Sulfonsäure oder auch einer anorganischen Säure abstammen. Bevorzugte Carbonsäuren sind Fettsäuren mit 1 - 18, insbesondere 1 - 6 C-Atomen, wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure, Buttersäure, Isobuttersäure, Valeriansäure, Isovaleriansäure, Capronsäure, Isocapronsäure,

Önanthsäure, Caprylsäure, Pelargonsäure, Caprinsäure, Laurinsäure, Myristinsäure, Palmitinsäure, Stearinsäure, ferner Crotonsäure, Ölsäure, Cyclohexancarbonsäure, Cyclohexylessig- und propionsäure, Benzoesäure, Phenylessig- und -propionsäure, Dicarbonsäuren wie Oxal-, Malon-, Bernstein-, Malein-, Glutar-, Dimethylglutar-, Adipin-, Pimelin-, Acetondicarbon-, Phthal-, Tetrahydrophthal-, Hexahydrophthal- oder Diglykolsäure, Hydroxycarbonsäuren wie Glykolsäure, Halogenfettsäuren wie Chloressigsäure, Dichloressigsäure, Trichloressigsäure oder Trifluoressigsäure.

Bevorzugte Sulfonsäuren sind solche, die von Alkylsulfonsäuren mit 1 - 6 C-Atomen abgeleitet sind, z.B. Methan- oder Äthansulfonsäure, und Arylsulfonsäuren mit 6 - 10 C-Atomen, z.B. Benzol-, p-Toluol-, 1- und 2-Naphthalinsulfonsäure. Bevorzugte anorganische Säuren sind Schwefelsäure und Phosphorsäure.

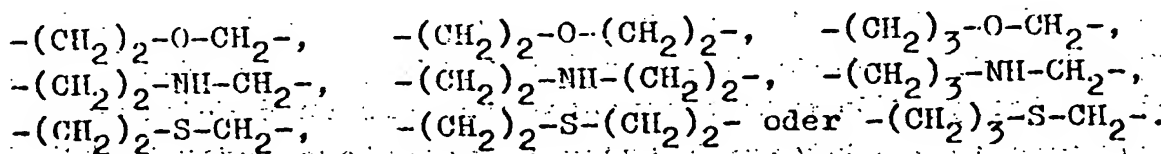
R^8 und R^9 können weiterhin z.B. bedeuten: Aralkyl mit vorzugsweise 7 - 19 C-Atomen, wie Benzyl, p-Methylbenzyl, 1- und 2-Phenyläthyl, Diphenylmethyl, Triphenylmethyl, oder 1- oder 2-Naphthylmethyl, Alkyl mit vorzugsweise bis zu 6 C-Atomen, insbesondere tert.-Butyl; Tetrahydropyranyl; oder Trialkylsilyl, vorzugsweise Trimethylsilyl.

R^7 ist entweder einer der bei R^3 angegebenen Reste oder eine funktionell abgewandelte OH-Gruppe, vorzugsweise eine z.B. mit einer gesättigten oder ungesättigten aliphatischen, cycloaliphatischen oder aromatischen, substituierten oder unsubstituierten Carbonsäure oder Sulfonsäure oder auch einer anorganischen Säure veresterten OH-Gruppe. Bevorzugte Säuren sind die bei R^8 bzw. R^9 genannten.

Funktionell abgewandeltes OH kann weiterhin eine verätherte OH-Gruppe bedeuten, z.B. Aralkoxy mit vorzugsweise 7 - 19 C-Atomen, wie Benzyloxy, p-Methylbenzyloxy, 1- und 2-Phenyläthoxy, Diphenylmethoxy, Triphenylmethoxy, oder 1- oder 2-Naphthylmethoxy; Alkoxy mit vorzugsweise bis zu 6 C-Atomen, insbesondere tert.-Butoxy; Tetrahydropyranyloxy; oder Trialkylsilyloxy, vorzugsweise Trimethylsilyloxy.

R^{10} ist entweder R^2 oder eine mit hydrogenolysierenden oder hydrolysierenden Mitteln abspaltbare Gruppe, es kann daher vorzugsweise einer der bei R^8 genannten Reste, insbesondere aber auch die Carbobenzoxy- oder die tert.-Butoxycarbonylgruppe bedeuten.

R^{11} ist ein in eine COOR^1 -Gruppe überführbarer, vorzugsweise oxidierbarer, thermolysierbarer, carboxylierbarer oder solvolysierbarer Rest, insbesondere eine CH_2OH - oder CHO -Gruppe; oder eine funktionell abgewandelte Carboxylgruppe, vorzugsweise eine Halogencarbonylgruppe wie $-\text{COCl}$ oder $-\text{COBr}$; eine stickstoffhaltige funktionell abgewandelte Carboxylgruppe, insbesondere $-\text{CON}_3$, $-\text{CONR}^{15}\text{R}^{16}$, $-\text{C}(=\text{NH})\text{OR}^{15}$, $-\text{C}(=\text{NR}^{15})\text{OR}^{16}$, $-\text{C}(=\text{NH})\text{NH}_2$, $-\text{CONHNH}_2$, $-\text{CONHOH}$, $-\text{C}\equiv\text{N}$, $-\text{C}(=\text{NH})\text{Cl}$, $-\text{C}(=\text{NH})\text{Br}$; eine schwefelhaltige funktionell abgewandelte Carboxylgruppe, insbesondere $-\text{COSR}^{15}$, $-\text{CSOR}^{15}$, $-\text{CSSR}^{15}$, $-\text{CSNR}^{15}\text{R}^{16}$; oder eine nur Sauerstoff enthaltende funktionell abgewandelte Carboxylgruppe, insbesondere $-\text{C}(\text{OR}^{15})_3$, $-\text{COOCOR}^{15}$ oder $-\text{COOR}^{15}$. R^{15} und R^{16} sind gleich oder ungleich und bedeuten neben H einen organischen Rest, beispielsweise Alkylgruppen, vorzugsweise unverzweigt mit insbesondere bis zu 4 C-Atomen; durch Cl, Br, J, OH, Alkoxy mit bis zu 4 C-Atomen, Acyloxy mit bis zu 4 C-Atomen, Phenyl oder Naphthyl substituiertes Alkyl mit bis zu 4 C-Atomen; Cycloalkyl mit bis zu 6 C-Atomen; gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Cl, Br, NO_2 , OH, Alkoxy mit bis zu 4 C-Atomen, Acyloxy mit bis zu 4 C-Atomen, substituiertes Aryl mit bis zu 10 C-Atomen; siliziumorganische Reste, vorzugsweise Trialkylsilyl, beispielsweise Trimethylsilyl; gemeinsam auch Polymethylen mit bis zu 6 C-Atomen, vorzugsweise unsubstituiertes Polymethylen mit bis zu 6 C-Atomen wie $-(\text{CH}_2)_4-$, $-(\text{CH}_2)_5-$ oder $-(\text{CH}_2)_6-$; aber insbesondere auch durch Methyl substituiertes Polymethylen, wie 1-Methyl-trimethylen; oder gemeinsam auch ein durch O, N oder S-Atome unterbrochenes Polymethylen mit vorzugsweise bis zu 6 C-Atomen, wie



R^{11} kann aber auch $-\text{CH}=\text{CHR}^{17}$, $-\text{CH}=\text{CR}^{15}\text{R}^{16}$, $-\text{CHOH}-\text{CHOH}-\text{R}^{15}$, $-\text{CHOH}-\text{CO}-\text{R}^{15}$, $-\text{CHOH}-\text{COOR}^{15}$, $-\text{CHOH}-\text{CHNHR}^{15}$, $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{R}^{15}$, $-\text{CO}-\text{R}^{17}$ oder $-\text{CH}_2-\text{R}^{18}$ sein, R^{17} bedeutet hier H oder einen beliebigen organischen Rest, vorzugsweise R^1 , CN oder COOH; da derjenige Teil des Moleküls, der den Rest R^{17} trägt, oxydativ entfernt wird, ist die Bedeutung des Restes R^{17} nicht kritisch. R^{18} bedeutet eine Borwasserstoff-, Boralkyl- oder Aluminiumalkylgruppe.

Außerdem kann R^{11} auch ein Äquivalent eines Metallatoms vorzugsweise eines Alkalimetall- oder Erdalkalimetallatoms, insbesondere Li oder MgX bedeuten.

W und Y sind gleich oder ungleich und bedeuten neben OR^6 oder Cl, Br oder J auch noch Alkylsulfonyloxy mit bis zu 4 C-Atomen, vorzugsweise unsubstituiertes Alkylsulfonyloxy, insbesondere Methylsulfonyloxy oder Äthylsulfonyloxy, aber auch Butylsulfonyloxy; substituiertes Alkylsulfonyloxy, wie 2-Hydroxy-äthylsulfonyloxy; oder Arylsulfonyloxy mit bis zu 10 C-Atomen, wie p-Tolylsulfonyloxy, p-Bromphenylsulfonyloxy, α -Naphthylsulfonyloxy oder β -Naphthylsulfonyloxy.

Z kann neben R^3 , Cl, Br oder J ebenfalls Alkylsulfonyloxy mit bis zu 4 C-Atomen oder Arylsulfonyloxy mit bis zu 10 C-Atomen bedeuten, es handelt sich daher vorzugsweise um einen bei W und Y genannten Rest.

A ist eine gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Cl, Br oder J substituierte Alkylen-, Cycloalkylen-, Arylalkylen- oder Arylengruppe mit jeweils bis zu 12 C-Atomen, welche sich von dem Rest R^1 durch Entfernung eines weiteren H-Atoms ableitet.

Bevorzugt sind die zweiwertigen Gruppen, die sich von den bei R^1 genannten einwertigen Gruppen ableiten; A kann aber auch einen Valenzstrich bedeuten.

U bedeutet neben Cl, Br, J auch Alkylsulfonyloxy mit bis zu 4 C-Atomen oder Arylsulfonyloxy mit bis zu 10 C-Atomen; es handelt sich daher vorzugsweise um einen der bei W und Y genannten Rest.

Die Buchstaben a,b,c,d,e,f,g und h bedeuten jeweils 0 oder 1, wobei zu beachten ist, daß Buchstaben, welche in einer Formel vorkommen, nicht gleich sein können, und a stets ungleich c und e stets ungleich g ist.

Bei den Verbindungen der Formel II handelt es sich um substituierte 1,4-Dialkoxy-, 1,4-Diaralkoxy-, 1,4-Diacyloxy-, 1-Alkoxy-4-aralkoxy-, 1-Aralkoxy-4-alkoxy-, 1-Alkoxy-4-acyloxy-, 1-Acyloxy-4-alkoxy-, 1-Aralkoxy-4-acyloxy- oder 1-Acyloxy-4-aralkoxy-cyclopentane, vorzugsweise um substituierte 1,4-Dialkoxy-3-N-alkylamino-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Diaralkoxy-3-N-alkylamino-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Diacyloxy-3-N-alkylamino-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Dialkoxy-3-N,N-dialkylamino-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Diaralkoxy-3-N,N-dialkylamino-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Diacyloxy-3-N,N-dialkylamino-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Dialkoxy-3-N-(2-hydroxyalkylamino)-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Diaralkoxy-3-N-(2-hydroxyalkylamino)-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Diacyloxy-3-N-(2-hydroxyalkylamino)-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Dialkoxy-3-N-alkyl-N-(2-hydroxyalkylamino)-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Diaralkoxy-3-N-alkyl-N-(2-hydroxyalkylamino)-2-omega-carboxyalkyloxy-oder 1,4-Diacyloxy-3-N-alkyl-N-(2-hydroxyalkylamino)-2-omega-carboxyalkyloxy-cyclopentane, sowie deren Ester, vorzugsweise Alkylester; insbesondere um 1,4-Di-tert.-Butoxy-3-N-alkylamino-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Dibenzyloxy-3-N-alkylamino-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Di-tert.-butoxy-3-N,N-dialkylamino-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Dibenzyloxy-3-N,N-dialkylamino-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Di-tert.-Butoxy-3-N-(2-hydroxyalkylamino)-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Dibenzyl-oxy-3-N-(2-hydroxyalkylamino)-2-omega-carboxyalkyloxy-, 1,4-Di-tert.-Butoxy-3-N-alkyl-N-(2-hydroxyalkylamino)-2-omega-carboxyalkyloxy- oder 1,4-Dibenzyloxy-3-N-alkyl-N-(2-hydroxy-

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☒ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☒ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.

THIS PAGE BLANK (USPTO)